

特 許 協 力 条 約

REC'D 05 AUG 2004

WIPO PCT

PCT

特許性に関する国際予備報告 (特許協力条約第二章)

(法第12条、法施行規則第56条)
[PCT36条及びPCT規則70]

出願人又は代理人 の書類記号 A31487N	今後の手続きについては、様式PCT/IPEA/416を参照すること。	
国際出願番号 PCT/JPO3/09651	国際出願日 (日.月.年) 30.07.03	優先日 (日.月.年) 07.11.02
国際特許分類 (IPC) Int.Cl. A61K7/48, 7/00, 31/19, 31/215, 35/78, A61P17/16, 43/00		
出願人 (氏名又は名称) 株式会社コーセー		

1. この報告書は、PCT35条に基づきこの国際予備審査機関で作成された国際予備審査報告である。 法施行規則第57条 (PCT36条) の規定に従い送付する。	
2. この国際予備審査報告は、この表紙を含めて全部で 3 ページからなる。	
3. この報告には次の附属物件も添付されている。	
a	<input checked="" type="checkbox"/> 附属書類は全部で 4 ページである。
	<input checked="" type="checkbox"/> 補正されて、この報告の基礎とされた及び/又はこの国際予備審査機関が認めた訂正を含む明細書、請求の範囲及び/又は図面の用紙 (PCT規則70.16及び実施細則第607号参照)
	<input type="checkbox"/> 第I欄4.及び補充欄に示したように、出願時における国際出願の開示の範囲を超えた補正を含むものとこの国際予備審査機関が認定した差替え用紙
b	<input type="checkbox"/> 電子媒体は全部で (電子媒体の種類、数を示す)。 配列表に関する補充欄に示すように、コンピュータ読み取り可能な形式による配列表又は配列表に関連するテーブルを含む。 (実施細則第802号参照)
4. この国際予備審査報告は、次の内容を含む。	
<input checked="" type="checkbox"/>	第I欄 国際予備審査報告の基礎
<input type="checkbox"/>	第II欄 優先権
<input type="checkbox"/>	第III欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての国際予備審査報告の不作成
<input type="checkbox"/>	第IV欄 発明の単一性の欠如
<input checked="" type="checkbox"/>	第V欄 PCT35条(2)に規定する新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解、それを裏付けるための文献及び説明
<input type="checkbox"/>	第VI欄 ある種の引用文献
<input type="checkbox"/>	第VII欄 国際出願の不備
<input type="checkbox"/>	第VIII欄 国際出願に対する意見

国際予備審査の請求書を受理した日 03.03.2004	国際予備審査報告を作成した日 13.07.2004	
名称及びあて先 日本国特許庁 (IPEA/JPO) 郵便番号100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号	特許庁審査官 (権限のある職員) 森井 裕美	4C 9737
電話番号 03-3581-1101 内線 3402		

様式PCT/IPEA/409 (表紙) (2004年1月)

BEST AVAILABLE COPY

第I欄 報告の基礎

1. この国際予備審査報告は、下記に示す場合を除くほか、国際出願の言語を基礎とした。

☐ この報告は、_____ 語による翻訳文を基礎とした。

それは、次の目的で提出された翻訳文の言語である。

- ☐ PCT規則12.3及び23.1(b)という国際調査
☐ PCT規則12.4という国際公開
☐ PCT規則55.2又は55.3という国際予備審査

2. この報告は下記の出願書類を基礎とした。(法第6条(PCT14条)の規定に基づく命令に応答するために提出された差替え用紙は、この報告において「出願時」とし、この報告に添付していない。)

☐ 出願時の国際出願書類

☒ 明細書

第 1-84 ページ、出願時に提出されたもの

第 _____ ページ*、 _____ 付けで国際予備審査機関が受理したもの

第 _____ ページ*、 _____ 付けで国際予備審査機関が受理したもの

☒ 請求の範囲

第 _____ 項、出願時に提出されたもの

第 _____ 項*、PCT19条の規定に基づき補正されたもの

第 1-3, 9-10 項*、10.06.2004 付けで国際予備審査機関が受理したもの

第 _____ 項*、 _____ 付けで国際予備審査機関が受理したもの

☐ 図面

第 _____ ページ/図、出願時に提出されたもの

第 _____ ページ/図*、 _____ 付けで国際予備審査機関が受理したもの

第 _____ ページ/図*、 _____ 付けで国際予備審査機関が受理したもの

☐ 配列表又は関連するテーブル

配列表に関する補充欄を参照すること。

3. ☒ 補正により、下記の書類が削除された。

☐ 明細書 第 _____ ページ

☒ 請求の範囲 第 4-8 項

☐ 図面 第 _____ ページ/図

☐ 配列表(具体的に記載すること)

☐ 配列表に関連するテーブル(具体的に記載すること)

4. ☐ この報告は、補充欄に示したように、この報告に添付されかつ以下に示した補正が出願時における開示の範囲を超えてされたものと認められるので、その補正がされなかったものとして作成した。(PCT規則70.2(c))

☐ 明細書 第 _____ ページ

☐ 請求の範囲 第 _____ 項

☐ 図面 第 _____ ページ/図

☐ 配列表(具体的に記載すること)

☐ 配列表に関連するテーブル(具体的に記載すること)

* 4. に該当する場合、その用紙に“superseded”と記入されることがある。

第V欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての法第12条(PCT35条(2))に定める見解、それを裏付ける文献及び説明

1. 見解

新規性 (N)	請求の範囲	1-3, 9-10	有 無
	請求の範囲		
進歩性 (IS)	請求の範囲		有 無
	請求の範囲	1-3, 9-10	
産業上の利用可能性 (IA)	請求の範囲	1-3, 9-10	有 無
	請求の範囲		

2. 文献及び説明 (PCT規則70.7)

国際調査報告では以下の文献が引用されている。

文献1: EP 970693 A1 (TAKASAGO INT CORP.)

文献2: JP 7-206654 A (ポーラ化成工業株式会社)

文献3: JP 11-60467 A (高砂香料株式会社)

文献4: WO 01/26670 A1 (日清製油株式会社)

文献5: JP 9-291011 A (株式会社コーセー)

文献1にはこの出願の式(1)で表される化合物と同一の化合物を含有するメラニン産生抑制剤、細胞賦活剤、皮膚外用剤が記載されており、係る剤を製造するにあたって、汎用の美白剤、細胞賦活剤、保湿剤、酸化防止剤も添加して良い旨が記載されている。

文献2-3には、何れもメラニン産生抑制剤に係る発明が記載されており、その有効成分として文献2にはこの出願の式(1)で表される化合物と同一の化合物が、そして文献3にはCistus ladaniferus L. 抽出物が開示されている。

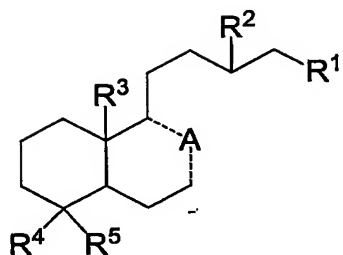
そして、文献4には美白剤としてヨクイニン抽出物が、文献5にはチロシナーゼ活性阻害剤としてカンゾウ抽出物、センブリ抽出物、ケイソウ抽出物、ヨクイニン抽出物が開示されている。

したがって、文献1に記載の皮膚外用剤に添加し得る汎用の美白剤として、文献4-5に記載の植物抽出物を選択することは自明であると認められることから、そうしてみると、この出願における(B)成分のうち、カンゾウ抽出物、センブリ抽出物、ケイソウ抽出物、ヨクイニン抽出物については、依然として上記各文献からその構成を容易に導き得るものと認められる。

そして、その効果を検討しても、他の美白剤と比較して、予測し得ないほどに格別に優れた効果が存するものとは認められない。

請 求 の 範 囲

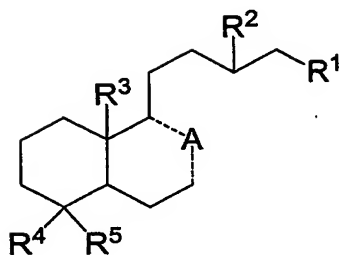
1. (補正後) (A) 下記一般式 (1) :



(一般式 (1) 中、 R^1 は $-\text{CH}_2\text{OH}$ 又は COOR^6 を表し、 R^6 は水素、炭素数が 1 ~ 3 の低級アルキル基又は COO^- と塩を形成し得るカチオンを表し、 $R^2 \sim R^5$ は各々独立して水素原子又はメチル基を表し、 $\cdots A \cdots$ は $=\text{C}(\text{CH}_3)-$ 、 $-\text{C}(\text{CH}_3)=$ 、 $-\text{C}(=\text{CH}_2)-$ 、 $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$ 又は $-\text{C}(\text{OH})(\text{CH}_3)-$ を表す。) で表される化合物の 1 種又は 2 種以上と、

(B) カンゾウ抽出物、ヨクイニン抽出物、ブラックカラント (クロフサスグリ) 果実抽出物、センブリ (オグルマ) 抽出物、クランベリー果実抽出物、ケイソウ抽出物、サボテン抽出物、羅漢果抽出物、アスタキサンチン及びその誘導体からなる薬効剤群より選ばれる 1 種又は 2 種以上とを含有する皮膚外用剤。

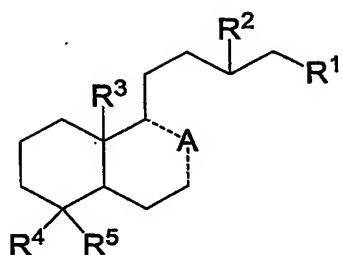
2. (補正後) (A) 下記一般式 (1) :



(一般式 (1) 中、 R^1 は $-\text{CH}_2\text{OH}$ 又は COOR^6 を表し、 R^6 は水素、炭素数が 1 ~ 3 の低級アルキル基又は COO^- と塩を形成し得るカチオンを表し、 $R^2 \sim R^5$ は各々独立して水素原子又はメチル基を表し、 $\cdots A \cdots$ は $=\text{C}(\text{CH}_3)-$ 、 $-\text{C}(\text{CH}_3)=$ 、 $-\text{C}(=\text{CH}_2)-$ 、 $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$ 又は $-\text{C}(\text{OH})(\text{CH}_3)-$ を表す。) で表される化合物の 1 種又は 2 種以上と、

(B) カンゾウ抽出物、ヨクイニン抽出物、ブラックカラント (クロフサスグリ) 果実抽出物、センブリ (オグルマ) 抽出物、クランベリー果実抽出物、ケイソウ抽出物、サボテン抽出物、羅漢果抽出物、アスタキサンチン及びその誘導体からなる薬効剤群より選ばれる 1 種又は 2 種以上とを含有する美白用皮膚外用剤。

3. (補正後) (A) 下記一般式(1):



(一般式(1)中、 R^1 は $-\text{CH}_2\text{OH}$ 又は COOR^6 を表し、 R^6 は水素、炭素数が1～3の低級アルキル基又は COO^- と塩を形成し得るカチオンを表し、 $R^2 \sim R^5$ は各々独立して水素原子又はメチル基を表し、 $\cdots A \cdots$ は $=\text{C}(\text{CH}_3)-$ 、 $-\text{C}(\text{CH}_3)=$ 、 $-\text{C}(=\text{CH}_2)-$ 、 $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$ 又は $-\text{C}(\text{OH})(\text{CH}_3)-$ を表す。)で表される化合物の1種又は2種以上と、

(B1) サボテン抽出物、アスタキサンチン及びその誘導体からなる薬効剤群より選ばれる1種又は2種以上とを含有する老化防止用皮膚外用剤。

4. (削除)

5. (削除)

6. (削除)

7. (削除)

8. (削除)

9. (補正後) 前記一般式(1)で表される化合物が、ハンニチバナ科の *Cistus ladaniferus* L.、*Cistus creticus* L.、*Cistus monoperiensis* L. 及び *Cistus salvifolius* からなる植物体群から選ばれる1種又は2種以上の植物体から抽出された化合物、又は該化合物から調製された化合物である請求の範囲第1項～第3項のいずれかの皮膚外用剤。

10. (補正後) 前記一般式(1)で表される化合物を含有する、ハンニチバナ科の *Cistus ladaniferus* L.、*Cistus creticus* L.、*Cistus monoperiensis* L. 及び *Cistus salvifolius* からなる植物体群から選ばれる1種又は2種以上の抽出物を配合してなる請求の範囲第1項～第3項のいずれかの皮膚外用剤。

Translation

PATENT COOPERATION TREATY

PCT

INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY
(Chapter II of the Patent Cooperation Treaty)

(PCT Article 36 and Rule 70)

PCT/JP2003/009651 14 APR 2005

PCT/JP2003/009651



531289

Applicant's or agent's file reference A31487N	FOR FURTHER ACTION See Form PCT/IPEA/416	
International application No. PCT/JP2003/009651	International filing date (day/month/year) 30 July 2003 (30.07.2003)	Priority date (day/month/year) 07 November 2002 (07.11.2002)
International Patent Classification (IPC) or national classification and IPC A61K 7/48, 7/00, 31/19, 31/215, 35/78, A61P 17/16, 43/00		
Applicant KOSE CORPORATION		

- This report is the international preliminary examination report, established by this International Preliminary Examining Authority under Article 35 and transmitted to the applicant according to Article 36.
- This REPORT consists of a total of 4 sheets, including this cover sheet.
- This report is also accompanied by ANNEXES, comprising:
 - ☒ (sent to the applicant and to the International Bureau) a total of 4 sheets, as follows:
 - ☒ sheets of the description, claims and/or drawings which have been amended and are the basis of this report and/or sheets containing rectifications authorized by this Authority (see Rule 70.16 and Section 607 of the Administrative Instructions).
 - ☐ sheets which supersede earlier sheets, but which this Authority considers contain an amendment that goes beyond the disclosure in the international application as filed, as indicated in item 4 of Box No. I and the Supplemental Box.
 - ☐ (sent to the International Bureau only) a total of _____, containing a sequence listing and/or tables related thereto, in computer readable form only, as indicated in the Supplemental Box Relating to Sequence Listing (see Section 802 of the Administrative Instructions).

- This report contains indications relating to the following items:
 - ☒ Box No. I Basis of the report
 - ☐ Box No. II Priority
 - ☐ Box No. III Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability
 - ☐ Box No. IV Lack of unity of invention
 - ☒ Box No. V Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement
 - ☐ Box No. VI Certain documents cited
 - ☐ Box No. VII Certain defects in the international application
 - ☐ Box No. VIII Certain observations on the international application

Date of submission of the demand 03 March 2004 (03.03.2004)	Date of completion of this report 13 July 2004 (13.07.2004)
Name and mailing address of the IPEA/JP	Authorized officer
Facsimile No.	Telephone No.

INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY

International application No.

PCT/JP2003/009651

Box No. I Basis of the report

1. With regard to the language, this report is based on the international application in the language in which it was filed, unless otherwise indicated under this item.

- ☐ This report is based on translations from the original language into the following language _____, which is language of a translation furnished for the purpose of:
- ☐ international search (under Rules 12.3 and 23.1(b))
 - ☐ publication of the international application (under Rule 12.4)
 - ☐ international preliminary examination (under Rules 55.2 and/or 55.3)

2. With regard to the elements of the international application, this report is based on *(replacement sheets which have been furnished to the receiving Office in response to an invitation under Article 14 are referred to in this report as "originally filed" and are not annexed to this report)*:

- ☐ The international application as originally filed/furnished
- ☒ the description:
- pages _____ 1-84 _____, as originally filed/furnished
- pages* _____ received by this Authority on _____
- pages* _____ received by this Authority on _____
- ☒ the claims:
- pages _____, as originally filed/furnished
- pages* _____, as amended (together with any statement) under Article 19
- pages* 1-3, 9-10 received by this Authority on 10 June 2004 (10.06.2004)
- pages* _____ received by this Authority on _____
- ☐ the drawings:
- pages _____, as originally filed/furnished
- pages* _____ received by this Authority on _____
- pages* _____ received by this Authority on _____
- ☐ a sequence listing and/or any related table(s) – see Supplemental Box Relating to Sequence Listing.

3. ☒ The amendments have resulted in the cancellation of:

- ☐ the description, pages _____
- ☒ the claims, Nos. _____ 4-8 _____
- ☐ the drawings, sheets/figs _____
- ☐ the sequence listing (*specify*): _____
- ☐ any table(s) related to sequence listing (*specify*): _____

4. ☐ This report has been established as if (some of) the amendments annexed to this report and listed below had not been made, since they have been considered to go beyond the disclosure as filed, as indicated in the Supplemental Box (Rule 70.2(c)).

- ☐ the description, pages _____
- ☐ the claims, Nos. _____
- ☐ the drawings, sheets/figs _____
- ☐ the sequence listing (*specify*): _____
- ☐ any table(s) related to sequence listing (*specify*): _____

* If item 4 applies, some or all of those sheets may be marked "superseded."

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.

PCT/JP 03/09651

V. Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement**1. Statement**

Novelty (N)	Claims	1-3, 9-10	YES
	Claims		NO
Inventive step (IS)	Claims		YES
	Claims	1-3, 9-10	NO
Industrial applicability (IA)	Claims	1-3, 9-10	YES
	Claims		NO

2. Citations and explanations

The following documents are cited in the international search report.

Document 1: EP 970693 A1 (Takasago Int. Corp.)
Document 2: JP 7-206654 A (Pola Chemical Ind., Inc.)
Document 3: JP 11-60467 A (Takasago Int. Corp.)
Document 4: WO 01/26670 A1 (The Nisshin Oil Mills, Ltd.)
Document 5: JP 9-291011 A (Kose Corp.)

Document 1 discloses melanin production inhibitors, cell activators and agents for external use on the skin which contain compounds that are identical to the compounds represented by formula (1) set forth in the present application, and indicates that it is acceptable to add conventional whitening agents, cell activators, heat insulating agents and anti-oxidizing agents thereto when producing the agents in question.

Documents 2 to 3 disclose inventions that are related to melanin production inhibitors. Therein, document 2 indicates a compound which is identical to the compounds represented by formula (1) set forth in the present application as an active ingredient, whereas document 3 indicates an extract from *Cistus ladaniferus* L. as an active ingredient.

In addition, document 4 presents an extract from *Coix lachryma-jobi* as a whitening agent, and document 5 presents an extract from liquorice, an extract from *Inula japonica*, an extract from *Millettia reticulata* and an extract from *Coix lachryma-jobi* as tyrosinase activity inhibitors.

Thus, it is considered to be obvious to select the plant extracts that are disclosed in documents 4 to 5 for use as the conventional whitening agents which can be added to the agents for external use on the skin that are disclosed in document 1. As a result, it is considered to have been easy to derive the configuration wherein an extract from liquorice, an extract from *Inula japonica*, an extract from *Millettia reticulata* and an extract from *Coix lachryma-jobi* are included among the (B) components in the inventions set forth in the present application in the light of the abovementioned documents.

Furthermore, an investigation of the effects of the inventions in questions shows that in comparison to other whitening agents, said inventions cannot be considered to exhibit a significantly superior effect that could not have been predicted.